

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

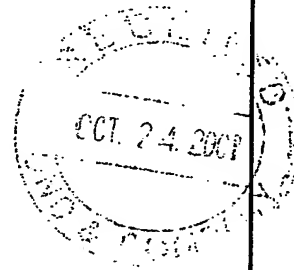
From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION CONCERNING  
SUBMISSION OR TRANSMITTAL  
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

ONO, Nobuo  
Mitobe Bldg. 4F  
1-13-1, Kandaizumi-cho  
Chiyoda-ku, Tokyo 101-0024  
Japan



Date of mailing (day/month/year) 17 October 2003 (17.10.03)	<b>IMPORTANT NOTIFICATION</b>
Applicant's or agent's file reference PF-030007-WO	
International application No. PCT/JP03/08517	International filing date (day/month/year) 04 July 2003 (04.07.03)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 05 July 2002 (05.07.02)
Applicant KOSE CORPORATION et al	

- The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
- An asterisk(\*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

<u>Priority date</u>	<u>Priority application No.</u>	<u>Country or regional Office or PCT receiving Office</u>	<u>Date of receipt of priority document</u>
05 July 2002 (05.07.02)	2002-196852	JP	22 Augu 2003 (22.08.03)

<p>The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland</p> <p>Facsimile No. (41-22) 338.90.90</p>	<p>Authorized officer Farid ABBOU</p> <p>Telephone No. (41-22) 338 8169</p>
---	---

DOCKET NO.: 263756US0PCT

**IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE**

IN RE APPLICATION OF: Yukako FUJIWARA  
 SERIAL NO.: NEW U.S. PCT APPLICATION  
 FILED: HERewith  
 INTERNATIONAL APPLICATION NO.: PCT/JP03/08517  
 INTERNATIONAL FILING DATE: July 4, 2003  
 FOR: VESICLE DISPERSION AND COSMETIC CONTAINING THE SAME

**REQUEST FOR PRIORITY UNDER 35 U.S.C. 119  
 AND THE INTERNATIONAL CONVENTION**

Commissioner for Patents  
 Alexandria, Virginia 22313


Sir:

In the matter of the above-identified application for patent, notice is hereby given that the applicant claims as priority:

<b><u>COUNTRY</u></b>	<b><u>APPLICATION NO</u></b>	<b><u>DAY/MONTH/YEAR</u></b>
Japan	2002-196852	05 July 2002

Certified copies of the corresponding Convention application(s) were submitted to the International Bureau in PCT Application No. PCT/JP03/08517. Receipt of the certified copy(s) by the International Bureau in a timely manner under PCT Rule 17.1(a) has been acknowledged as evidenced by the attached PCT/IB/304.

Respectfully submitted,  
 OBLON, SPIVAK, McCLELLAND,  
 MAIER & NEUSTADT, P.C.



Norman F. Oblon  
 Attorney of Record  
 Registration No. 24,618  
 Surinder Sachar  
 Registration No. 34,423

Customer Number

**22850**

(703) 413-3000  
 Fax No. (703) 413-2220  
 (OSMMN 08/03)

PCT/JPC3/08517

日本国特許庁  
JAPAN PATENT OFFICE

04.07.03

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日  
Date of Application: 2002年 7月 5日

出願番号  
Application Number: 特願2002-196852  
[ST. 10/C]: [JP 2002-196852]

出願人  
Applicant(s): 株式会社コーセー

REC'D 22 AUG 2003

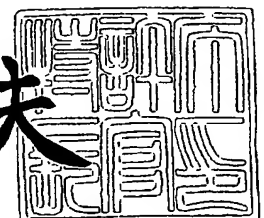
WIPO PCT

PRIORITY DOCUMENT  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)

2003年 8月 7日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

今井康夫



【書類名】 特許願

【整理番号】 P0001475

【提出日】 平成14年 7月 5日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 A61K 7/00  
B01J 13/00

【発明者】

【住所又は居所】 東京都北区栄町 4 8 番 1 8 号 株式会社コーセー研究本部内

【氏名】 藤原 由佳子

【特許出願人】

【識別番号】 000145862

【住所又は居所】 東京都中央区日本橋 3 丁目 6 番 2 号

【氏名又は名称】 株式会社コーセー

【代表者】 小林 保清

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 054759

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【ブルーフの要否】 要

【書類名】 明細書

【発明の名称】 ベシクル分散物及びこれを含有する化粧品

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 次の成分(A)、(B)、(C)；

(A) ショ糖脂肪酸エステル

(B) スフィンゴシン及び／またはその誘導体

(C) 水性成分

を構成成分とすることを特徴とするベシクル分散物。

【請求項 2】 (A) 成分の一部または全てが親水性のショ糖脂肪酸エステルであることを特徴とする請求項 1 に記載のベシクル分散物。

【請求項 3】 (B) 成分が(A) 成分に対し、0.1～40 質量％であることを特徴とする請求項 1 または 2 に記載のベシクル分散物。

【請求項 4】 (B) 成分がセラミドであることを特徴とする請求項 1～3 のいずれかに記載のベシクル分散物。

【請求項 5】 (A) 成分のショ糖脂肪酸エステルを構成する脂肪酸の一部が、不飽和脂肪酸であることを特徴とする請求項 1～4 のいずれかに記載のベシクル分散物。

【請求項 6】 さらに(D) 成分として、融点が80℃以下の脂肪酸及び／または高級アルコールを含有することを特徴とする請求項 1～5 のいずれかに記載のベシクル分散物。

【請求項 7】 さらに(E) 成分として、(A) 成分に対し、0.1～10 質量％のステロール類を含有することを特徴とする請求項 1～6 のいずれかに記載のベシクル分散物。

【請求項 8】 請求項 1～7 に記載のベシクル分散物を含有することを特徴とする化粧品。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】

本発明は保湿効果に優れた成分を安定に含有したベシクル分散物および該ベシ

クル分散物を含有する化粧品に関する。

#### 【0 0 0 2】

##### 【従来の技術】

セラミド等の角質細胞間脂質が、角質層のバリアー機能に深く関わっていることが明らかにされて以来、これを配合した保湿剤の開発が試みられていたが、セラミド類は結晶性が高く、安定性の観点から化粧品への配合量には自ずと制約があり、多量に配合できないのが現状であった。従って、セラミドの有する水分保持機能をより効果的に発現するために、セラミドを多量に配合しても安定で、結晶析出等の問題を生じることのない化粧料の開発が望まれていた。そこで、脂質と界面活性剤と油剤との液晶を利用する方法（特開平6-345633号公報）、脂質と界面活性剤を有機溶媒から析出せしめた複合体とする方法（特開平11-199462号公報）あるいはリポソーム（リン脂質二分子膜からなるベシクル）を用いる方法等が検討されてきた。

#### 【0 0 0 3】

##### 【発明が解決しようとする課題】

しかしながら、セラミド等のスフィンゴシン類は、一般に油剤への溶解性が悪いため、比較的多量の界面活性剤や溶媒類が必要であり、化粧品としての安全性に問題があったり、有機溶媒が不要な化粧品に配合する場合は、複合体を得るために使用した大量の有機溶剤を完全に除去する技術が必要であった。また、リン脂質は一般的に不安定な物質であり、化粧品として長期保存安定性を確保することが難しかった。本発明は、前記従来技術の課題に鑑みなされたものであり、その目的は長期にわたって安定で、保湿効果に優れたベシクル分散物を得ることにある。

#### 【0 0 0 4】

##### 【課題を解決するための手段】

かかる実状において、本発明者が鋭意検討を進めた結果、シヨ糖脂肪酸エステル、スフィンゴシン類と水性成分とを構成成分とすることにより、極めて安定なベシクル構造が容易に得られることを見いだした。すなわち、本発明にかかるベシクル分散物は、シヨ糖脂肪酸エステル、スフィンゴシン及び／またはその誘導

体と水性成分とを構成成分をすることを特徴とし、さらに該ベシクル分散物を含有する化粧料は、ベタつきがなく、浸透感、保湿感に優れることを見だし、本発明を完成した。

# 【0005】

## 【発明の実施の形態】

以下、本発明の構成を詳細に説明する。

本発明のベシクル分散物を構成する（A）成分であるシヨ糖脂肪酸エステルは、通常化粧料に使用されるものであればいずれのものも使用できる。シヨ糖は分子中に8個の水酸基を持っており、その置換度はいずれのものも使用できるが、中でもモノエステル、ジエステル、トリエステルが好ましく、それらエステル化度の異なるシヨ糖脂肪酸エステルの混合物であってもよい。また反応する脂肪酸は、炭素数が8～24の飽和または不飽和の、直鎖あるいは分岐を持つものが好ましく、ジエステル以上の場合、同一でも異なる脂肪酸であってもよいが、中でもパルミチン酸、ステアリン酸、イソステアリン酸、リノレン酸が好ましい。これらのシヨ糖脂肪酸エステルとしては、例えばシヨ糖モノステアレート、シヨ糖ジイソステアレート、シヨ糖ジパルミテート、シヨ糖トリリノレート等があげられ、これらの1種または2種以上を用いることができる。

また、長期にわたる安定性を確保するという点において、（A）成分の一部または全てが親水性のシヨ糖脂肪酸エステルであることが好ましく、さらに、（A）成分のシヨ糖脂肪酸エステルを構成する脂肪酸の一部が、オレイン酸やリノレン酸等の不飽和脂肪酸であれば、皮膚上で抗酸化剤としてはたらき、老化防止に役立つという点で好ましい。

# 【0006】

本発明のベシクル分散物を構成する（B）成分であるスフィンゴシン及び／またはその誘導体としては、スフィンゴシン骨格を持つ物質であればいずれでもよく、例えばフィトスフィンゴシン、セラミド、スフィンゴミエリン、セレプロシド等があげられ、これらの1種または2種以上を用いることができる。

特に、（B）成分がセラミドである場合、高融点であるため通常化粧料への配合が困難であるが、安定配合することが可能になるという点、あるいは皮膚の水

分保持力を増大し、化粧品製剤の保湿効果を高めるという点において好ましい。化粧品に使用されているセラミドとしては、酵母を利用して生成したセラミド、化学合成による擬似セラミド、植物から得られたセラミド等があり、例えばセラミド1～6があげられるが、中でもセラミド2、セラミド3、セラミド6が好ましい。

(A) 成分と (B) 成分の構成比は特に限定されないが、保湿効果またはベシクル分散物の安定性の点において、(B) 成分が (A) 成分に対し 0.1～40 質量% (以下単に「%」と示す) であることが好ましい。

#### 【0007】

本発明のベシクル分散物を構成する (C) 成分である水性成分としては、水に可溶な成分であればいずれでもよく、例えば、エチルアルコール、イソプロピルアルコール等のアルコール類、プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリエチレングリコール等のグリコール類、グリセリン、ジグリセリン、ポリグリセリン等のグリセロール類、アロエベラ、ウィッチハーゼル、ハマメリス、キュウリ、レモン、ラベンダー、ローズ等の植物抽出液等及び水が挙げられ、これらの1種または2種以上を用いることができるが、水あるいは水との混合物であることが好ましい。

#### 【0008】

さらに本発明のベシクル分散物の構成成分として (D) 成分の脂肪酸及び／または高級アルコールを含有することにより、スフィンゴシン類との相溶性により結晶析出を抑制し、ベシクルの安定性が向上する。(D) 成分の脂肪酸及び／または高級アルコールとしては、融点が80℃以下のものであれば飽和または不飽和であっても、分岐または直鎖であってもいずれでもよく、その1種または2種以上を用いることができるが、例えばイソステアリン酸、イソセチルアルコール等の分岐を持つものが好ましい。

#### 【0009】

さらに本発明のベシクル分散物の構成成分として (E) 成分のステロール類を含有することにより、ベシクルの安定性や皮膚の保湿効果が格段に向上する。(E) 成分のステロール類としてはステロール骨格を持つ物質あるいはその誘導体



であればいずれでもよく、例えばコレステロール、フィトステロール、マカデミアンナッツ油脂肪酸コレステリル、ヤシ油脂肪酸コレステリル、N-ラウロイル-L-グルタミン酸ジ（コレステリル・ベヘニル・オクチルドデシル）等があげられ、その1種または2種以上を用いることができるが、中でもコレステロール、フィトステロールが好ましい。また、（E）成分の含有量は（A）成分に対して0.1～10%が好ましく、この範囲であれば、ベシクル分散物の安定性や皮膚の保湿効果をさらに向上させることができる。

#### 【0010】

本発明におけるベシクル分散物とは、脂質の多層膜からなる小胞体が水性成分に分散したものであるが、構成成分としては少なくとも（A）～（C）を含有するものであり、ベシクルを形成する主成分である（A）成分及び（B）成分の総量が、ベシクル分散物中0.1～70%であることが好ましい。さらに、ベシクル成分との相互作用により安定性をそこなわない程度で、これら必須成分に加え、（D）成分、（E）成分や後述する通常化粧品に使用されるその他の成分を含有することができ、ベシクルの膜および内部に、脂溶性あるいは水溶性の有効成分を含むことができる。

#### 【0011】

脂溶性あるいは水溶性の有効成分としては、例えば、コウジ酸、アスコルビン酸及びその誘導体、甘草抽出物等の美白剤、グリチルリチン酸、グリチルレチン酸及びそれらの誘導体、グリチルリチン酸及びその誘導体、アズレン等の抗炎症剤、レチノール、ビタミンA誘導体、塩酸ピリドキシン及びその誘導体、ニコチン酸誘導体、ビタミンE及びその誘導体等のビタミン類、ヒスチジン、アルギニン、セリン等のアミノ酸、ブチルヒドロキシトルエン等の抗酸化剤、などがあげられ、これらの1種または2種以上を用いることができる。

#### 【0012】

ベシクル分散物の製造方法としては、T<sub>c</sub>温度（ゲル-液晶転移温度）以上で、ベシクルを構成する成分を十分水に膨潤させた後、攪拌・混合する方法（特許3126193号公報）や、有機溶媒を用いて、リン脂質の薄膜を形成させた後、水または水溶液を添加して、例えば超音波照射により微小なリポソームを得る

方法等があるが、本発明のベシクル分散物は除去の必要な有機溶媒を用いなくとも、ジプロピレングリコール等の水溶性溶媒にベシクル成分を溶解し、水相に添加することにより、容易にベシクル分散物を調製でき、通常の攪拌器のみで直径  $0.2 \mu\text{m}$  以下のベシクル分散物を得ることもできる。

### 【0013】

本発明のベシクル分散物は、化粧料に配合することができるが、化粧料の形態は特に限定されず、溶液系、可溶化系、乳化系、油性系、粉体系、あるいはそれらの系をあわせ持つ、二層型、三層型等、あらゆる剤型が可能である。また本発明の化粧料はスキンケア化粧料、頭髮化粧料、メーキャップ化粧料とすることができるが、好ましくはスキンケア化粧料である。中でも、保湿効果の発現のために、化粧水、乳液、クリーム等の水性剤型であるとよい。本発明のベシクル分散物の配合量は、各剤型について  $0.1 \sim 100\%$  が好ましい。

### 【0014】

本発明の化粧料には、上記の必須成分の他に、通常の化粧料に使用される成分、例えば、水性成分、保湿剤、油剤、界面活性剤、増粘剤、粉体、色素、紫外線吸収剤、被膜形成性剤、pH調整剤、褪色防止剤、酸化防止剤、消泡剤、美容成分、防腐剤、香料、など適宜配合することができる。

### 【0015】

具体的には、水性成分としては、(C)成分であげたものに加えて、ソルビトール、マルチトール、ショ糖等の糖類、塩化ナトリウム、塩化マグネシウム、乳酸ナトリウム等の電解質類も用いることができる。

保湿剤としては、タンパク質、ムコ多糖、コラーゲン、エラスチン、ケラチン等があげられる。

油剤としては、動物油、植物油、合成油等の起源、及び、固形油、半固形油、液体油、揮発性油等の性状を問わず、炭化水素類、油脂類、ロウ類、硬化油類、エステル油類、脂肪酸類、高級アルコール類、シリコン油類、フッ素系油類、ラノリン誘導体類、油性ゲル化剤類等が挙げられる。具体的には、流動パラフィン、スクワラン、ワセリン、ポリブテン、パラフィンワックス、セレスインワックス、マイクロクリスタリンワックス、ポリエチレンワックス、エチレン・プロピ

レンコポリマー、モンタンワックス、フィッシュートロブシュワックス等の炭化水素類、モクロウ、オリーブ油、ヒマシ油、ミンク油、マカデミアンナッツ油等の油脂類、ミツロウ、カルナウバワックス、キャンデリラワックス、ホホバ油、ゲイロウ等のロウ類、リンゴ酸ジイソステアリル、セチルイソオクタネート、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ミリスチン酸オクチルドデシル、トリオクタン酸グリセリル、ジイソステアリン酸ポリグリセリル、トリイソステアリン酸ジグリセリル、トリベヘン酸グリセリル、ジオクタン酸ネオペンチルグリコール、コレステロール脂肪酸エステル等のエステル類、ステアリン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、ベヘン酸、イソステアリン酸、オレイン酸等の脂肪酸類、ステアリルアルコール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、オレイルアルコール、イソステアリルアルコール、ベヘニルアルコール等の高級アルコール類、低重合度ジメチルポリシロキサン、高重合度ジメチルポリシロキサン、メチルフェニルポリシロキサン、デカメチルシクロペンタシロキサン、オクタメチルシクロテトラシロキサン、ポリエーテル変性オルガノポリシロキサン、ポリオキシアルキレン・アルキルメチルポリシロキサン・メチルポリシロキサン共重合体、アルコキシ変性ポリシロキサン、架橋型オルガノポリシロキサン、フッ素変性オルガノポリシロキサン等のシリコン類、パーフルオロデカン、パーフルオロオクタン、パーフルオロポリエーテル等のフッ素系油剤類、ラノリン、酢酸ラノリン、ラノリン脂肪酸イソプロピル、ラノリンアルコール等のラノリン誘導体、デキストリン脂肪酸エステル、蔗糖脂肪酸エステル、12-ヒドロキシステアリン酸、デンプン脂肪酸エステル、イソステアリン酸アルミニウム、ステアリン酸カルシウム等の油性ゲル化剤類等が挙げられる。

#### 【0016】

界面活性剤としては、化粧品一般に用いられている界面活性剤であればいずれのものも使用でき、非イオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤、カチオン性界面活性剤、両性界面活性剤等が挙げられる。非イオン界面活性剤としては、例えば、グリセリン脂肪酸エステル及びそのアルキレングリコール付加物、ポリグリセリン脂肪酸エステル及びそのアルキレングリコール付加物、プロピレングリコール脂肪酸エステル及びそのアルキレングリコール付加物、ソルビタン脂肪酸

エステル及びそのアルキレングリコール付加物、ソルビトールの脂肪酸エステル及びそのアルキレングリコール付加物、ポリアルキレングリコール脂肪酸エステル、蔗糖脂肪酸エステル、ポリオキシアルキレンアルキルエーテル、グリセリンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ラノリンのアルキレングリコール付加物、ポリオキシアルキレンアルキル共変性オルガノポリシロキサン、ポリエーテル変性オルガノポリシロキサン等が挙げられる。アニオン界面活性剤としては、例えば、ステアリン酸、ラウリン酸のような脂肪酸の無機及び有機塩、アルキルベンゼン硫酸塩、アルキルスルホン酸塩、 $\alpha$ -オレフィンスルホン酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、 $\alpha$ -スルホン化脂肪酸塩、アシルメチルタウリン塩、N-メチル-N-アルキルタウリン塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル硫酸塩、アルキル燐酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル燐酸塩、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル燐酸塩、N-アシルアミノ酸塩、N-アシル-N-アルキルアミノ酸塩、 $o$ -アルキル置換リンゴ酸塩、アルキルスルホコハク酸塩等が挙げられる。カチオン界面活性剤としては、例えば、アルキルアミン塩、ポリアミン及びアルカノールアミン脂肪酸誘導体、アルキル四級アンモニウム塩、環式四級アンモニウム塩等が挙げられる。両性界面活性剤としては、アミノ酸タイプやベタインタイプのカルボン酸型、硫酸エステル型、スルホン酸型、リン酸エステル型のものがあり、人体に対して安全とされるものが使用できる。例えば、N, N-ジメチル-N-アルキル-N-カルボキシルメチルアンモニウムベタイン、N, N-ジアルキルアミノアルキレンカルボン酸、N, N, N-トリアルキル-N-スルフォアルキレンアンモニウムベタイン、N, N-ジアルキル-N, N-ビス(ポリオキシエチレン硫酸)アンモニウムベタイン、2-アルキル-1-ヒドロキシエチル-1-カルボキシメチルイミダゾリニウムベタイン、レシチン等が挙げられる。

#### 【 0 0 1 7 】

増粘剤としては、グアーガム、コンドロイチン硫酸ナトリウム、ヒアルロン酸ナトリウム、アラビアガム、アルギン酸ナトリウム、カラギーナン、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキ-

シビニルポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸ナトリウム等の水溶性高分子等が挙げられる。

#### 【0018】

粉体成分としては、板状、紡錘状、針状、球状等の形状、粒子径、多孔質、無孔質等の粒子構造等により特に限定されず、無機粉体類、光輝性粉体類、有機粉体類、色素粉体類、複合粉体類、等が挙げられる。具体的には、コンジョウ、群青、ベンガラ、黄酸化鉄、黒酸化鉄、酸化チタン、酸化亜鉛、酸化アルミニウム、酸化セリウム、二酸化珪素、酸化マグネシウム、酸化ジルコニウム、炭酸マグネシウム、炭酸カルシウム、酸化クロム、水酸化クロム、カーボンブラック、ケイ酸アルミニウム、ケイ酸マグネシウム、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、マイカ、合成マイカ、合成セリサイト、セリサイト、タルク、カオリン、無水ケイ酸、炭化珪素、硫酸バリウム、ペントナイト、スメクタイト、窒化硼素等の無機粉体類、オキシ塩化ビスマス、雲母チタン、酸化鉄コーティング雲母、酸化鉄雲母チタン、有機顔料処理雲母チタン、アルミニウムパウダー等の光輝性粉体類、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸亜鉛、N-アシルリジン、ナイロン等の有機粉体類、有機タール系顔料、有機色素のレーキ顔料等の色素粉体類、微粒子酸化チタン被覆雲母チタン、微粒子酸化亜鉛被覆雲母チタン、硫酸バリウム被覆雲母チタン、酸化チタン含有二酸化珪素、酸化亜鉛含有二酸化珪素等の複合粉体、ポリエチレンテレフタレート・アルミニウム・エポキシ積層末、ポリエチレンテレフタレート・ポリオレフィン積層フィルム末、ポリエチレンテレフタレート・ポリメチルメタクリレート積層フィルム末等があげられ、これらを1種又は2種以上を用いることができる。また、これら粉体は1種又は2種以上の複合化したものを用いても良く、フッ素化合物、シリコーン系油剤、金属石ケン、ロウ、界面活性剤、油脂、炭化水素等を用いて公知の方法により表面処理を施したものであっても良い。

#### 【0019】

紫外線吸収剤としては、例えばベンゾフェノン系、PABA系、ケイ皮酸系、サリチル酸系、4-tert-ブチル-4'-メトキシジベンゾイルメタン、オキシベンゾン等、被膜形成剤としては(メタ)アクリル酸アルキル共重合体等の

エマルションポリマー形態のもの、pH調整剤としては、乳酸、クエン酸等の $\alpha$ -ヒドロキシ酸及びその塩、エデト酸塩、酸化防止剤としては、例えば $\alpha$ -トコフェロール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸等、美容成分としては、例えばビタミン類、消炎剤、生薬等の薬効成分、防腐剤としては、例えばパラオキシ安息香酸エステル、フェノキシエタノール等があげられる

### 【0020】

#### 【実施例】

以下、実施例をあげて本発明をさらに詳細に説明する。これらによって本発明の技術的範囲が限定されるものではない。

### 【0021】

#### 実施例1～4、比較例1

#### (製造方法)

##### 実施例1：ベシクル分散物1

セラミド(\*1) 0.1gとイソステアリン酸0.1gを秤量し、90℃で加熱混合した後、0.5gのショ糖脂肪酸エステル(\*2)を分散したジプロピレングリコール4gを加え、70℃で均一に混合した。これを70℃の精製水10gに添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、ベシクル分散物1((B)成分が(A)成分に対し20%)を得た。

\*1 セラミド2

\*2 DKエステル S-160 (第一工業製薬社製)

##### 実施例2：ベシクル分散物2

セラミド(\*3) 0.01gとイソステアリン酸0.1gを秤量し、90℃で加熱混合した後、0.5gのショ糖脂肪酸エステル(\*2)を分散したジプロピレングリコール4gを加え、70℃で均一に混合した。これを70℃の精製水10gに添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、ベシクル分散物2((B)成分が(A)成分に対し2%)を得た。

\*3 セラミド3

##### 実施例3：ベシクル分散物3

セラミド(\*1) 0.2gとイソステアリン酸0.1gを秤量し、90℃で加

熱混合した後、0.5 g のシヨ糖脂肪酸エステル (\*2) を分散したジプロピレングリコール 4 g を加え、70℃で均一に混合した。これを70℃の精製水 10 g に添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、ベシクル分散物 3 ((B) 成分が (A) 成分に対し 40%) を得た。

#### 実施例 4 : ベシクル分散物 4

セラミド (\*1) 0.005 g とフィトステロール 0.005 g とイソステアリン酸 0.1 g を秤量し、90℃で加熱混合した後、0.5 g のシヨ糖脂肪酸エステル (\*2) を分散したジプロピレングリコール 4 g を加え、70℃で均一に混合した。これを70℃の精製水 10 g に添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、ベシクル分散物 4 ((B) 成分が (A) 成分に対し 1%) を得た。

#### 比較例 1 : ベシクル分散物 5

イソステアリン酸 0.1 g とシヨ糖脂肪酸エステル (\*2) 0.5 g を、ジプロピレングリコール 4 g を加えて70℃で均一に混合した。これを精製水 5 g に添加し、攪拌分散することにより、ベシクル分散物 5 を得た。

### 【0022】

得られたベシクル分散物について、下記の方法により分散安定性と保湿効果の評価を行い判定した。その結果を表 1 に示す。

### 【0023】

(評価方法)

#### a. 分散安定性

各試料を 40℃の恒温槽に 1 ヶ月放置した後、結晶物の析出および濁度の変化を、次に示す判定基準により目視で判断した。

(判定)

◎ : 全く認められない。

○ : ほとんど認められない。

△ : やや認められる。

× : 明らかに認められる。(沈澱又はクリーミングが認められる)

### 【0024】

#### b. 保湿効果

10名の官能検査パネルにより、各試料を上腕に塗布し、6時間後の状態を（  
1）絶対評価基準を用いて7段階に評価し、各試料ごとの評点の平均値を（2）  
4段階判定基準を用いて判定した。

（1）絶対評価基準

（評点）：（評価）

6：非常に良い

5：良い

4：やや良い

3：普通

2：やや悪い

1：悪い

0：非常に悪い

（2）4段階判定基準

5点を超える：非常に良好：◎

3点を超えて5点以下：良好：○

2点を超えて3点以下：やや不良：△

2点以下：不良：×

【0025】

【表1】

評価項目及び 判定結果	実施例				比較例
	1	2	3	4	1
	ベシクル 分散物1	ベシクル 分散物2	ベシクル 分散物3	ベシクル 分散物4	ベシクル 分散物5
a.分散安定性	◎	◎	○	◎	△
b.保湿効果	◎	○	◎	○	△

【0026】

実施例5～7および比較例2～3 化粧水

表2に示す組成の化粧水を調製し、分散安定性、保湿効果、ベタつきのなさ、  
においのなさ、について下記の方法により評価を行い判定した。その結果を併せ  
て表2に示す。



【0027】

【表2】

No. 成分	実施例			比較例	
	5	6	7	2	3
1 本発明のベシクル分散物1	15	5	30	-	-
2 参考例1のリポソーム	-	-	-	15	-
3 参考例2の乳化物	-	-	-	-	15
4 1,3-ブチレングリコール	6	6	6	6	6
5 グリセリン	5	5	5	5	5
6 クエン酸	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
7 クエン酸ナトリウム	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
8 精製水	残量	残量	残量	残量	残量
9 POE(30)ヘニルエーテル	0.5	0.5	0.5	0.5	0.5
10 パラオキシ安息香酸メチル	適量	適量	適量	適量	適量
11 エチルアルコール	8	8	8	8	8
12 香料	適量	適量	適量	適量	適量
評価項目及び判定結果					
a. 分散安定性	◎	◎	○	△	×
b. 保湿効果	◎	○	◎	◎	△
c. ベタつきのなさ	◎	◎	○	△	○
d. においの変化	○	○	○	×	○

【0028】

(製造方法)

実施例5～7：ベシクル化粧水

表2に示される成分1～8を混合溶解し、これに成分9～12を混合溶解したものを添加して攪拌し、ベシクル化粧水を得た。

比較例2：リポソーム化粧水

表2に示される成分1～8を混合溶解し、これに成分9～12を混合溶解したものを添加して攪拌し、リポソーム化粧水を得た。

参考例1；リポソーム

セラミド(\*1) 0.1gとイソステアリン酸0.05gとコレステロール0.05gを秤量し、90℃で加熱混合した後、0.5gのリン脂質(\*4)を分散したジプロピレングリコール4gを加え、70℃で均一に混合した。これを7

0℃の精製水10gに添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、リポソームを得た。

\* 4 卵黄レシチン PL-100P (キューピー社製)

比較例 3：乳化化粧水

表 2 に示される成分 1 ～ 8 を混合溶解し、これに成分 9 ～ 1 2 を混合溶解したものを添加して攪拌し、乳化化粧水を得た。

参考例 2；乳化物

セラミド (\* 1) 0. 1 g とイソステアリン酸 0. 1 g を秤量し、90℃で加熱混合した後、0. 5 g のポリオキシエチレン (60E. O.) 硬化ヒマシ油を分散したジプロピレングリコール 4 g を加え、70℃で均一に混合した。これを70℃の精製水10gに添加し、攪拌分散した後、冷却することにより、乳化物を得た。

【0029】

(評価項目)

- a. 分散安定性
- b. 保湿効果
- c. ベタつきのなさ
- d. においの変化

(評価方法)

- a. の項目については、前記 a. 分散安定性の評価方法を用いて判定した。
- b、c の項目については、各試料について実際に顔に塗布し、前記 b. 保湿効果の評価方法と判断基準を用いて判定した。
- d. におい判定

各試料を 40℃の恒温槽に 1 ヶ月放置した後、室温に戻し、ビン口でのにおいの変化を室温保管品と比較し、次に示す判定基準により判断した。

(判定)

- ◎：ほとんどない。
- ：少しある。
- △：ある。

×：かなりある。

実施例 5～7 のベシクル化粧水は、保湿効果と使用感に優れ、分散安定性も良好な化粧水であった。また、実施例 5～7 で用いた本発明のベシクル分散物 1 に代えて、ベシクル分散物 2～4 を用いたところ、分散安定性、保湿効果、ベタつきのなさ、においの変化の全ての点において良好なものが得られた。一方、比較例 2 のリポソーム化粧水はベタつきのなさ、及び経時における匂いの変化において、また、比較例 3 の乳化化粧水は分散安定性、保湿効果において、劣るものであった。

### 【 0 0 3 0 】

#### 実施例 8：クリーム

(成分)	(%)
1. ステアリン酸	1. 5
2. セトステアリルアルコール	3. 0
3. グリセリルモノステアレート	1. 5
4. スクワラン	2 0. 0
5. ワセリン	5. 0
6. グリセリン	7. 0
7. 1, 3-ブチレングリコール	5. 0
8. 本発明のベシクル分散物 * 5	3 0. 0
9. 乳酸ソーダ	1. 0
1 0. キサンタンガム	0. 0 5
1 1. 防腐剤	適 量
1 2. 水酸化カリウム	0. 0 5
1 3. EDTA-2Na	0. 0 2
1 4. 精製水	残 量
1 5. 香料	適 量

\* 5 ベシクル分散物 1～4 をそれぞれ用いた。

#### (製造方法)

A：成分 1～5、15 を 7 0℃にて加熱混合する。

B: 成分 6 ~ 14 を 70℃ にて加熱混合する。

C: A に B を添加して攪拌し、これを冷却してクリームを得た。

実施例 8 のクリームは、ベシクル分散物 1 ~ 4 のいずれのものを用いた場合も、保湿感に優れ、安定性も良好であった。

### 【0031】

#### 実施例 9: 乳液

(成分)	(%)
1. スクワラン	3.0
2. シリコン	1.0
3. ポリオキシエチレン (60) 硬化ヒマシ油	1.5
4. セトステアリルアルコール	0.3
5. 本発明のベシクル分散物 * 5	15.0
6. ジプロピレングリコール	7.0
7. グリセリン	5.0
8. アクリル酸メタクリル酸アルキル共重合体	0.1
9. 防腐剤	適量
10. 水酸化ナトリウム	0.03
11. EDTA-2Na	0.02
12. 香料	適量
13. 精製水	残量

#### (製造方法)

A: 成分 1 ~ 7 を 70℃ にて加熱混合する。

B: 成分 8 ~ 13 を 70℃ にて加熱混合する。

C: B に A を添加して攪拌し、これを冷却して乳液を得た。

実施例 9 の乳液は、ベシクル分散物 1 ~ 4 のいずれのものを用いた場合も、保湿感に優れ、安定性も良好であった。

### 【0032】

#### 実施例 10: アイスティッククリーム

(成分)	(%)
------	-----

1. キャンデリラワックス	3. 0
2. ポリエチレンワックス	6. 0
3. マイクロクリスタリンワックス	2. 5
4. セレシンワックス	6. 0
5. パラフィン	10. 0
6. トリイソオクタン酸グリセリル	10. 0
7. 流動パラフィン	残 量
8. 煙霧状シリカ	1. 0
9. グリセリン	3. 0
10. 本発明のベシクル分散物 * 5	5. 0

(製造方法)

A: 1~7を100℃にて均一溶解する。

B: Aに8~10を加え、均一に混合分散する。

C: Bをスティック容器に流し込み、冷却固化してアイスティッククリームを得た。

実施例10のアイスティッククリームは、どのベシクル分散物を用いた場合も、保湿感に優れ、安定性も良好であった。

### 【0033】

実施例11: スティック状口紅

(成分)	(%)
1. エチレンプロピレンコポリマー	5. 0
2. ポリエチレンワックス	5. 0
3. キャンデリラワックス	7. 0
4. 酢酸液状ラノリン	10. 0
5. トリイソステアリン酸ジグリセリル	残 量
6. ジイソステアリン酸ジグリセリル	3. 0
7. ポリブテン (分子量700)	10. 0
8. 流動パラフィン	5. 0
9. 本発明のベシクル分散物 * 6	0. 5

10. 本発明のベシクル分散物 * 7	0. 3
11. 赤色 202 号	0. 1
12. 黄色 4 号アルミニウムレーキ	1. 5
13. 酸化チタン	2. 0
14. 黒酸化鉄	0. 2
15. 煙霧状シリカ	3. 0
16. ビタミン E	0. 5
17. 香料	適 量

\* 6 ベシクル分散物 1 ~ 4 の精製水をそれぞれ 5 g にした他は、ベシクル分散物 1 と同様の方法で調製したベシクル

\* 7 セレブロシド 0. 1 g とセチルアルコール 0. 1 g を秤量し、70℃で加熱混合した後、シヨ糖イソステアリン酸エステル（親水性）0. 4 g シヨ糖リノール酸エステル（親油性）0. 1 g とグリセリン 4 g を加え、70℃で均一に混合した。これを 70℃の精製水 5 g に添加し、攪拌分散した後、冷却することによりベシクル分散物を得た。

（製法）

A：成分 1 ~ 8 を均一に加熱溶解する。

B：A に成分 9 ~ 16 を均一に混合する。

C：B を型に熔融充填し、冷却してスティック状口紅を得た。

実施例 11 のスティック状口紅は、\* 7 のベシクル分散物とベシクル分散物 1 ~ 4 のいずれのものを組み合わせて使用した場合も、べたつきのなさ、保湿感といった点で優れたものであり、特に肌あたりが滑らかなものであった。

#### 【0034】

実施例 12：美容液

（成分）	（%）
1. 本発明のベシクル分散物 * 8	40. 0
2. 本発明のベシクル分散物 * 9	30. 0
3. エチルアルコール	3. 0
4. グリセリン	3. 0

5. ヒアルロン酸ナトリウム

10.0

6. 精製水

残 量

7. 香料

適 量

\*8 ベシクル分散物1～4のセラミドに代えて、スフィンゴミエリンを用い、ジプロピレングリコールを半量にした他は、ベシクル分散物1～4と同様の方法で調製したベシクル

\*9 セラミド(\*1) 0.1gとイソステアリン酸0.1gを秤量し、90℃で加熱混合した後、ショ糖脂肪酸エステル(\*2) 0.4gを分散したジプロピレングリコール4gとショ糖リノレン酸エステル0.1g、ビタミンE 0.05gを加え、70℃で均一に混合した。これを、ヒスチジン0.1gを溶解した70℃の精製水10gに添加し、攪拌分散した後、冷却することによりベシクル分散物を得た。

(製法)

A: 成分1～7を均一に混合する。

実施例12の美容液は、\*9のベシクル分散物と\*8の4種のベシクル分散物のいずれのものを組み合わせて使用した場合も、保湿感に優れ、安定性も良好であった。

【0035】

【発明の効果】

以上説明したように、本発明のベシクル分散物および化粧料は、ショ糖脂肪酸エステル、スフィンゴシン類、水性成分とを配合することにより、安定で保湿効果の高いものを容易に形成する。

【書類名】 要約書

【要約】

【課題】 保湿効果に優れた成分を安定に含有したベシクル分散物、および、該ベシクル分散物を含有し、ベタつきがなく、浸透感、保湿感に優れ、安定性も良好な化粧料に関する。

【解決手段】 ショ糖脂肪酸エステル、スフィンゴシン類と水性成分とを構成成分とするベシクル分散物および該ベシクル分散物を含有する化粧料を提供するものである。

【選択図】 なし



特願 2 0 0 2 - 1 9 6 8 5 2

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[ 0 0 0 1 4 5 8 6 2 ]

1. 変更年月日

1 9 9 1 年 8 月 2 3 日

[変更理由]

名称変更

住 所

東京都中央区日本橋 3 丁目 6 番 2 号

氏 名

株式会社コーセー